

none

none

none

©EPODOC / EPO

PN - CN1245059 A 20000223  
PD - 2000-02-23  
PR - CN19980114246 19980819  
OPD - 1998-08-19  
TI - Arginomycin medicine for vagina  
AB - An azithromycin medicine in the form of tablet (or effervescent tablet), capsule, film, or lotion is disclosed for treating vaginitis. The dosage of arginomycin per day is 0.025-2.0g.  
IN - CHANG JIANG (CN);CHU YUQIU (CN);WANG LIANHUA (CN)  
PA - PHARMACEUTICAL FACTORY NO5 JI (CN)  
IC - A61K31/70 ; A61K9/20 ; A61K9/48 ; A61K9/70 ; A61K9/08

© WPI / DERWENT

TI - Arginomycin medicine for vagina in the form of tablet (or effervescent tablet), capsule, film, or lotion  
PR - CN19980114246 19980819  
PN - CN1245059 A 20000223 DW200126 A61K31/70 001pp  
PA - (PHAR-N) PHARM FACTORY NO5 JINZHOU CITY  
IC - A61K9/08 ;A61K9/20 ;A61K9/48 ;A61K9/70 ;A61K31/70  
IN - CHANG J; CHU Y; WANG L  
AB - CN1245059 An azithromycin medicine in the form of tablet (or effervescent tablet), capsule, film, or lotion is disclosed for treating vaginitis. The dosage of arginomycin per day is 0.025-2.0g.  
- (Dwg.0)  
OPD - 1998-08-19  
AN - 2001-245471 [26]

none

none

none

THIS PAGE BLANK USE

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl?

A61K 31/70

A61K 9/20 A61K 9/48

A61K 9/70 A61K 9/08

## [12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 98114246.X

[43] 公开日 2000 年 2 月 23 日

[11] 公开号 CN 1245059A

[22] 申请日 1998.8.19 [21] 申请号 98114246.X

[71] 申请人 锦州市制药五厂

地址 121001 辽宁省锦州市古塔区人民街五段十六号常江

[72] 发明人 王连华 常江 祚玉秋

权利要求书 1 页 说明书 3 页 附图页数 0 页

[54] 发明名称 阿奇霉素阴道用药物制剂

[57] 摘要

本发明提供了一种治疗妇科阴道炎症的阴道用药物制剂，其剂型为片剂（包括泡腾片）、胶囊、膜剂、洗剂，药物一日用量阿奇霉素含量范围为 0.025 — 2.0g。

ISSN 1 0 0 8 - 4 2 7 4

## 权 利 要 求 书

---

- 1：一种治疗妇科阴道炎症的药物制剂，给药途径为阴道，其特征在于每日用该药中的阿奇霉素含量范围为：0.025 - 2.0 g。
- 2：权利要求1所述药物制剂可为片剂（包括泡腾片）、胶囊、膜剂、洗剂。
- 3：根据权利要求1或权利要求2中所述药物制剂，其中还含有适量赋型剂。
- 4：根据权利要求3所述赋型剂分别为片剂、胶囊、膜剂、洗剂的赋型剂。
- 5：根据权利要求1所述的药物制剂，其中的阿奇霉素包括其无水物、含水物以及盐。

## 说 明 书

### 阿奇霉素阴道用药物制剂

本发明属于一种治疗妇科疾病的药物，特别是涉及一种治疗妇科阴道炎症的局部治疗药物。

妇女阴道炎症可由多种微生物感染所致，为妇科常见病，多发病。特别是由支原体、衣原体等病原体感染的性传播疾病，近年来有上升趋势。目前治疗普通阴道炎症的药物较多，但治疗支原体、衣原体等感染的有效治疗药物尚欠缺。阿奇霉素是一种由红霉素A衍生的广谱抗菌药，具有抗菌作用强，作用时间长，副作用小等特点。本品不仅对革兰氏阳性菌、阴性菌有强大的抗菌作用，而且能有效地治疗由支原体、衣原体等引起的性传播疾病。美国 F D A 和性疾病控制中心已将阿奇霉素列为治疗生殖道性病的首选药物之一。

目前，市售品多为阿奇霉素片剂、胶囊、颗粒剂等口服剂型。然而，文献报道，阿奇霉素口服给药对胃肠道的副作用占9.6%，其中常见的副作用是腹泻(3.6%)、恶心(2.6%)、腹痛(2.5%) (HOPKINS, Am. J. med. 91 (suppl 3A (1991)) 40S - 45S)且阿奇霉素胶囊、片剂等经口服给药时，经胃吸收的药物只占投药量的37% (Foulds G, et al: The pharmacokinetics of azithromycin in human serum and tissues journal of Antimicrobial Chemotherapy 1990, (suppl A): 73 - 82)，其余部分被排除体外，造成浪费。

本发明的目的是提供一种不受胃肠道影响，并不对胃肠道产生副作用，直接作用于病灶的阿奇霉素制剂，从而避免了阿奇霉素对胃肠道的副作用，提高阿奇霉素的生物利用度，减少浪费。

本发明是经科学筛选，在药理学，药效学上反复实验及一期临床的应用实践研制而成。本发明的阿奇霉素含量范围为每日用量 0.025 - 2.0 g；剂型为：片剂（包括泡腾片）、胶囊剂、膜剂、洗剂。其赋型剂（药物载体）可分别为各剂型的赋型剂。

本发明与口服剂型相比，①可避免阿奇霉素对胃肠道的副作用。②可不受胃肠 P H 值及食物效应的影响，提高生物利用度，减少浪费。

下面用实施例进一步说明本发明

#### 实施例 1

阿奇霉素 2.5 g 酒石酸氢钾 0.193 g 碳酸氢钠 0.07 g  
甲基纤维素 0.0028 g 乳糖 0.145 g 淀粉 0.043 g  
淀粉浆 10% 适量 硬脂酸镁 0.5%

取甲基纤维素加适量蒸馏水浸泡，使溶解，与 10% 淀粉浆适量混合作粘合剂（1）。酒石酸氢钾过 80 目筛，加（1）适量制粒。取碳酸氢钠过 80 目筛，加（1）适量制粒。

以上二种颗粒分别置室温下干燥后整粒，混合均匀，加硬脂酸镁，混匀压片。制成 100 片。

#### 实施例 2

取阿奇霉素 5.0 g，过 80 目筛，加微粉硅胶适量，混匀，装入阴道用胶囊，制成 100 粒。

#### 实施例 3

处方：阿奇霉素 5.0 g PVA 0.5 - 8.8 1.25 g  
甘油 1.0 g 蒸馏水 适量（约 200 ml）

取 P V A 加甘油，水浸泡，待充分膨胀后，在水浴上加热溶解，加入阿奇霉素，搅拌均匀，静置，消去气泡，制成  $4.0 \times 4.0 \times 0.09\text{ mm}^3$  薄膜。每张内含 25.0 mg 主药。

实施例 4

取阿奇霉素乳酸盐（相当于阿奇霉素 5.0 g）加蒸馏水 15.0 ml，摇匀，继续加蒸馏水使成 20.0 ml，分装即得。

THIS PAGE BLANK (U.S. ....)